



Attorney's Docket No. 104035.274081

PATENT

**IN THE UNITED STATES PATENT AND TRADEMARK OFFICE**

In re: Wendel et al  
Appl. No.: 10/789,641  
Filed: February 27, 2004  
For: STABILIZATION OF OXIDATION-SENSITIVE OR UV-SENSITIVE ACTIVE INGREDIENTS

Confirmation No.: 9149

Commissioner for Patents  
P.O. Box 1450  
Alexandria, VA 22313-1450

**SUBMITTAL OF PRIORITY DOCUMENT**

To complete the requirements of 35 U.S.C. § 119, enclosed is a certified copy of Germany priority Application No. 101 41 475.7, filed August 29, 2001.

Respectfully submitted,

Andrew T. Meunier  
Registration No. 40,726

**Customer No. 00826**  
**Alston & Bird LLP**  
Bank of America Plaza  
101 South Tryon Street, Suite 4000  
Charlotte, NC 28280-4000  
Tel Charlotte Office (704) 444-1000  
Fax Charlotte Office (704) 444-1111

"Express Mail" mailing label number EV 354292985 US  
Date of Deposit August 20, 2004

I hereby certify that this paper or fee is being deposited with the United States Postal Service "Express Mail Post Office to Addressee" service under 37 CFR 1.10 on the date indicated above and is addressed to:  
Commissioner for Patents, P.O. Box 1450, Alexandria, VA 22313-1450

  
Teresa Wells

# BUNDESREPUBLIK DEUTSCHLAND

CERTIFIED COPY OF  
PRIORITY DOCUMENT



## Prioritätsbescheinigung über die Einreichung einer Patentanmeldung

**Aktenzeichen:** 101 41 475.7

**Anmeldetag:** 29. August 2001

**Anmelder/Inhaber:** Beiersdorf AG, 20253 Hamburg/DE

**Bezeichnung:** Stabilisierung oxidations- und/oder  
UV-empfindlicher Wirkstoffe

**IPC:** A 61 K 7/00

Die angehefteten Stücke sind eine richtige und genaue Wiedergabe der ursprünglichen Unterlagen dieser Patentanmeldung.

München, den 15. Juli 2004  
Deutsches Patent- und Markenamt  
Der Präsident  
Im Auftrag

Stanschus

A 9161  
06/00  
EDV-L

BEST AVAILABLE COPY

**Beiersdorf Aktiengesellschaft  
Hamburg**

5

**Beschreibung**

**Stabilisierung oxidations- und/oder UV-empfindlicher Wirkstoffe**

10

Die vorliegende Erfindung betrifft Stoffkombinationen zur Stabilisierung oxidations-empfindlicher bzw. UV-empfindlicher Wirkstoffe sowie kosmetische und dermatologische Formulierungen mit auf diese Weise stabilisierten oxidationsempfindlichen bzw. UV-empfindlichen Wirkstoffen. Insbesondere betrifft sie kosmetische und dermatologische Lichtschutzformulierungen und Formulierungen mit UV-empfindlichen Lichtschutzfiltersubstanzen, die durch den Einsatz dieser Stoffkombinationen stabilisiert werden.

15

20

Die schädigende Wirkung des ultravioletten Teils der Sonnenstrahlung auf die Haut ist allgemein bekannt. In Abhängigkeit von ihrer jeweiligen Wellenlänge haben die Strahlen verschiedene Wirkungen auf das Organ Haut: Die sogenannte UV-C-Strahlung mit einer Wellenlänge, die kleiner als 290 nm ist, wird von der Ozonschicht in der Erdatmosphäre absorbiert und hat daher keine physiologische Bedeutung. Dagegen verursachen Strahlen im Bereich zwischen 290 nm und 320 nm, dem sogenannten UV-B-Bereich, ein Erythem, einen einfachen Sonnenbrand oder sogar mehr oder weniger starke Verbrennungen. Als ein Maximum der Erythemwirksamkeit des Sonnenlichtes wird der engere Bereich um 308 nm angegeben.

25

Zum Schutz gegen UV-B-Strahlung sind zahlreiche Verbindungen bekannt, bei denen es sich beispielsweise um Derivate des 3-Benzylidencamphers, der 4-Aminobenzoessäure, der Zimtsäure, der Salicylsäure, des Benzophenons sowie des Triazins handelt.

30

Man hat lange Zeit fälschlicherweise angenommen, daß die langwellige UV-A-Strahlung mit einer Wellenlänge zwischen 320 nm und 400 nm nur eine vernachlässigbare biologische Wirkung aufweist. Inzwischen ist allerdings durch zahlreiche Studien belegt, daß UV-A-Strahlung im Hinblick auf die Auslösung photodynamischer, speziell phototoxischer Reaktionen und chronischer Veränderungen der Haut weitaus gefährlicher als UV-B-

Strahlung ist. Auch kann der schädigende Einfluß der UV-B-Strahlung durch UV-A-Strahlung noch verstärkt werden.

5 So ist es u. a. erwiesen, daß selbst die UV-A-Strahlung unter ganz normalen Alltagsbedingungen ausreicht, um innerhalb kurzer Zeit die Collagen- und Elastinfasern zu schädigen, die für die Struktur und Festigkeit der Haut von wesentlicher Bedeutung sind. Hierdurch kommt es zu chronischen lichtbedingten Hautveränderungen – die Haut „altert“ vorzeitig. Zum klinischen Erscheinungsbild der durch Licht gealterten Haut gehören beispielsweise Falten und Fältchen sowie ein unregelmäßiges, zerfurchtes Relief. Ferner  
10 können die von lichtbedingter Hautalterung betroffenen Partien eine unregelmäßige Pigmentierung aufweisen. Auch die Bildung von braunen Flecken, Keratosen und sogar Karzinomen bzw. malignen Melanomen ist möglich. Eine durch die alltägliche UV-Belastung vorzeitig gealterte Haut zeichnet sich außerdem durch eine geringere Aktivität der Langerhanszellen und eine leichte, chronische Entzündung aus.

15 Etwa 90 % der auf die Erde gelangenden ultravioletten Strahlung besteht aus UV-A-Strahlen. Während die UV-B-Strahlung in Abhängigkeit von zahlreichen Faktoren stark variiert (z. B. Jahres- und Tageszeit oder Breitengrad), bleibt die UV-A-Strahlung unabhängig von jahres- und tageszeitlichen oder geographischen Faktoren Tag für Tag relativ  
20 konstant. Gleichzeitig dringt der überwiegende Teil der UV-A-Strahlung in die lebende Epidermis ein, während etwa 70 % der UV-B-Strahlen von der Hornschicht zurückgehalten werden.

25 Es ist daher von grundsätzlicher Wichtigkeit, daß kosmetische und dermatologische Lichtschutzzubereitungen sowohl gegen UV-B- als auch gegen UV-A-Strahlung ausreichenden Schutz bieten.

Im allgemeinen ist das Lichtabsorptionsverhalten von Lichtschutzfiltersubstanzen sehr gut bekannt und dokumentiert, zumal in den meisten Industrieländern Positivlisten für den  
30 Einsatz solcher Substanzen existieren, welche recht strenge Maßstäbe an die Dokumentation anlegen.

Die Einsatzkonzentration bekannter als Feststoff vorliegender Lichtschutzfiltersubstanzen ist allerdings häufig – gerade in Kombination mit anderen zu lösenden Substanzen – be-

grenzt. Es bereitet daher gewisse formulierungstechnische Schwierigkeiten, höhere Lichtschutzfaktoren bzw. UV-A-Schutzleistung zu erzielen.

Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen sind z. B. Dibenzoylmethanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr. 70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird.

Der Hauptnachteil aller im UV-Bereich absorbierenden Dibenzoylmethanderivate ist eine gewisse Instabilität gegenüber UV-Strahlung, so daß diese Komponenten unter UV-Einfluß zu inaktiven Produkten zersetzt werden und für die UV-Absorption nicht mehr zur Verfügung stehen. Zubereitungen des Standes der Technik mit einem Gehalt an diesen Substanzen enthalten daher zweckmäßigerweise auch bestimmte UV-Stabilisatoren, wie beispielsweise Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen) oder 4-Methylbenzylidencampher.

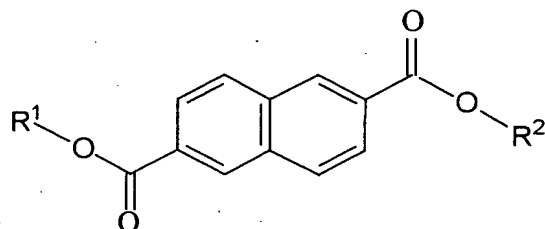
Es war eine Aufgabe der vorliegenden Erfindung, die Nachteile des Standes der Technik zu beseitigen und auf einfache Weise zu Zubereitungen zu gelangen, welche sich durch eine hohe UV-, insbesondere UV-A-Schutzleistung auszeichnen und in welchen auf den Einsatz üblicher UV-Stabilisatoren verzichtet werden kann.

Der Stand der Technik kennt ferner eine Reihe von verschiedenen effizienten, lipophilen Hautpflegewirkstoffen – wie beispielsweise Ubichinone, Retinoide und Carotinoide – die ungesättigte, aromatische oder benzoide Strukturelemente enthalten, deren Einsatz in kosmetischen und dermatologischen Formulierungen, insbesondere in Formulierungen vom Typ Öl-in-Wasser, sehr wünschenswert ist. Unglücklicherweise sind derartige Substanzen aber häufig sehr instabil, so daß sie insbesondere unter UV-Strahlung schnell zerfallen und auf diese Weise ihre Wirksamkeit verlieren.

Eine weitere Aufgabe der vorliegenden Erfindung war es daher, die Stabilität von oxidationsempfindlichen bzw. UV-empfindlichen Wirkstoffen zu erhöhen sowie stabile Zubereitungen mit oxidationsempfindlichen bzw. UV-empfindlichen Wirkstoffen zu schaffen, deren Wirksamkeit über einen langen Zeitraum erhalten bleibt.

Es war überraschend und für den Fachmann nicht vorauszusehen, daß kosmetische und dermatologische Formulierungen mit mindestens einem oxidations- und/oder UV-empfindlichen Wirkstoff, dadurch gekennzeichnet, daß sie

(a) mindestens ein Dialkylnaphthalat, welches sich durch die Strukturformel



5

auszeichnet,

worin  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen, und

10

(b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m enthalten,

den Nachteilen des Standes der Technik abhelfen.

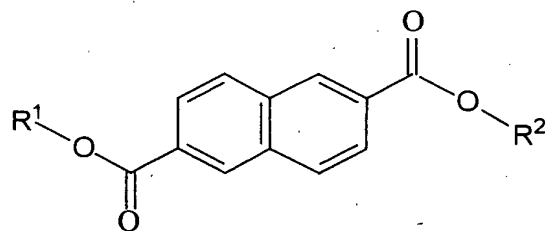
Liegen der oder die oxidations- und/oder UV-empfindlichen Wirkstoffe in einer erfindungsgemäßen Formulierung vor, so sind sie gegen die durch UV-Strahlung induzierte Zersetzung in hervorragender Weise geschützt. Dieses gilt insbesondere für Dibenzoylmethanderivate.

15

Gegenstand der Erfindung ist daher auch die

Verwendung von Stoffkombinationen, welche

(a) mindestens ein Dialkylnaphthalat, welches sich durch die Strukturformel



auszeichnet,

worin  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen,

25

und

- (b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m  
enthalten,

zur Stabilisierung kosmetischer oder dermatologischer Wirkstoffe gegen die durch UV-  
Strahlung induzierte Zersetzung.

Die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können bevorzugt neben einer  
oder mehrerer Ölphasen zusätzlich eine oder mehrere Wasserphasen enthalten und bei-  
spielsweise in Form von W/O-, O/W-, W/O/W- oder O/W/O-Emulsionen vorliegen. Solche  
Formulierungen können vorzugsweise auch eine Mikroemulsion, eine PIT-Emulsion, eine  
Feststoff-Emulsionen (d. h. eine Emulsion, welche durch Feststoffe stabilisiert ist, z. B.  
eine Pickering-Emulsion), eine sprühbare Emulsion oder eine Hydrodispersion sein.

Die erfindungsgemäßen Zubereitungen stellen in jeglicher Hinsicht überaus befriedi-  
gende Präparate dar, welche nicht auf eine eingeschränkte Rohstoffauswahl begrenzt  
sind. Dementsprechend eignen sie sich ganz besonders, um als Grundlage für Zuberei-  
tungsformen mit vielfältigen Anwendungszwecken zu dienen. Die erfindungsgemäßen  
Zubereitungen zeigen sehr gute sensorische und kosmetische Eigenschaften, wie bei-  
spielsweise die Verteilbarkeit auf der Haut oder das Einzugsvermögen in die Haut, und  
zeichnen sich ferner durch eine sehr gute Lichtschutzeffektivität bei gleichzeitig hervor-  
ragenden Hautpflegedaten aus.

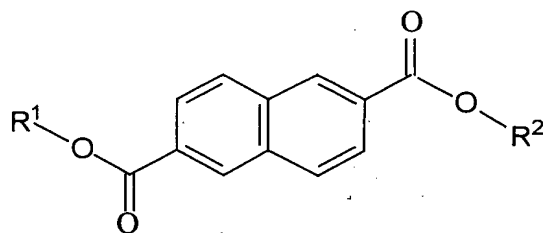
Es war insbesondere überraschend, daß bei der Verwendung gemäß der vorliegenden  
Erfindung gänzlich auf den Einsatz weiterer UV-Stabilisatoren, insbesondere auf den  
Einsatz von Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen) oder 4-Methylbenzyl-  
dencampher verzichtet werden kann.

Ferner läßt sich durch die erfindungsgemäße Verwendung überraschend die Stabilität  
von lipophilen Wirkstoffen in kosmetischen oder dermatologischen (O/W-) Formulie-  
rungen gegenüber dem Stand der Technik erheblich steigern.

Gegenstand der Erfindung ist daher auch die

Verwendung von Stoffkombinationen, welche

- (a) mindestens ein Dialkylnaphthalat, welches sich durch die Strukturformel



auszeichnet,

worin R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen, und

(b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m enthalten, zur Verbesserung der Wirksamkeit und zur Erhöhung der Stabilität von lipophilen Wirkstoffen in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen.

- 10 Vorteilhafte lipophile Wirkstoffe, welche durch die erfindungsgemäße Verwendung in hervorragender Weise stabilisiert werden, sind solche, deren log P-Wert größer als 3,5 ist. P ist der Verteilungskoeffizient, welcher definiert ist als das Verhältnis der Gleichgewichtskonzentrationen einer gelösten Substanz in einem Zwei-Phasen-System, welches aus zwei miteinander im wesentlichen nicht mischbaren Lösungsmitteln besteht. Diese beiden Lösungsmittel sind im vorliegenden Fall n-Octanol und Wasser, d. h.

$$P_{ow} = \frac{C_{n-Octanol}}{C_{Wasser}}$$

Es ist vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, den oder die lipophile(n) Wirkstoffe aus der Gruppe der Ubichinone und Plastochinone zu wählen. Ganz besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist Coenzym Q10, welches einen log P-Wert von etwa 15 hat.

Weitere erfindungsgemäß vorteilhafte lipophile Wirkstoffe sind Retinoide (Vitamin A-Säure und/oder deren Derivate) bzw. Vitamin A und/oder dessen Derivate. In die Gruppe der erfindungsgemäß vorteilhaften Retinoide werden begrifflich alle kosmetisch und/oder pharmazeutisch unbedenklichen Retinoide, einschließlich des Retinols und seiner Ester, des Retinals sowie der Retinoësäure (Vitamin A-Säure) und deren Ester einbezogen. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Retinol (mit einem log P-Wert von etwa 7) und Retinylpalmitat (mit einem log P-Wert von etwa 13).



Weitere erfindungsgemäß vorteilhafte lipophile Wirkstoffe sind Carotinoide. Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung ist beispielsweise das  $\beta$ -Carotin, welches einen log P-Wert von 15 hat.

5

Weitere erfindungsgemäß vorteilhafte lipophile Wirkstoffe sind:

- Liponsäure und Derivate,
- Vitamin E und Derivate,
- Vitamin F,
- 10 • Dioic Acid [8-Hexadecen-1,16-dicarbonsäure (CAS-Nummer 20701-68-2)]

Die Menge an lipophilen Wirkstoffen (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,0001 bis 10 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,001 bis 5 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

15

Vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dialkyl-naphthalate, für die  $R^1$  und/oder  $R^2$  verzweigte Alkylgruppen mit 6 bis 10 Kohlenstoffatomen darstellen. Ganz besonders bevorzugt im Sinne der vorliegenden Erfindung ist Diethylhexyl-naphthalat, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Hallbrite TQ™ von CP Hall oder  
20 Corapan TQ™ von H&R erhältlich ist.

Erfindungsgemäß vorteilhaft enthalten kosmetische oder dermatologische Zubereitungen 0,001 bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 20 Gew.-%, ganz besonders bevorzugt 0,5 bis 15 Gew.-% eines oder mehrerer Dialkyl-naphthalate.

25

Die Ölphase(n) der erfindungsgemäßen Zubereitungen wird/werden vorteilhaft gewählt aus der Gruppe der polaren Lipide mit einer Polarität  $\leq 30$  mN/m. Besonders vorteilhaft werden das oder die erfindungsgemäßen Lipide aus der Gruppe der Lipide mit einer Polarität von 5 bis 25 mN/m gewählt.

30

Besonders vorteilhafte Lipide im Sinne der vorliegenden Erfindung sind alle nativen Lipide, wie z. B. Olivenöl, Sonnenblumenöl, Sojaöl, Erdnußöl, Rapsöl, Mandelöl, Palmöl, Kokosöl, Rizinusöl, Weizenkeimöl, Traubenkernöl, Distelöl, Nachtkerzenöl, Macadamia-nußöl, Maiskeimöl, Avocadoöl und dergleichen sowie die im folgenden aufgelisteten.

Hersteller	Handelsname	INCI-Name	Polarität mN/m
Stearinerie Dubois Fils	DUB VCI 10	Isodecyl Neopentanoate	29,9
ALZO (ROVI)	Dermol IHD	Isohexyldecanoate	29,7
ALZO (ROVI)	Dermol 108	Isodecyl Octanoate	29,6
	Diethyl Ether	Diethyl Ether	29,2
ALZO (ROVI)	Dermol 109	Isodecyl 3,5,5 Trimethyl Hexanoate	29,1
Henkel Cognis	Cetiol SN	Cetearyl Isononanoate	28,6
Unichema	Isopropylpalmitat	Isopropylpalmitat	28,8
Dow Corning	DC Fluid 345	Cyclomethicone	28,5
Dow Corning	Dow Corning Fluid 244	Cyclopolydimethylsiloxan	28,5
Nikko Chemicals Superior Jojoba Oil Gold	Jojobaöl Gold		26,2
Wacker	Wacker AK 100	Dimethicone	26,9
ALZO (ROVI)	Dermol 98	2- Ethylhexanosäure 3,5,5 Trimethylester	26,2
Dow Corning	Dow Corning Fluid 246	Offen	25,3
Henkel Cognis	Eutanol G	Octyldodecanol	24,8
Condea Chemie	Isofol 16	Hexyl Decanol	24,3
ALZO (ROVI)	Dermol 139	Isotridecyl 3,5,5 Trimethylhexanonanoate	24,5
Henkel Cognis	Cetiol PGL	Hexyldecanol (+) Hexyl Decyl Laurate	24,3
	Cegesoft C24	Octyl Palmitate	23,1
Gattefossé	M.O.D.	Octyldodeceyl Myristate	22,1
	Macadamia Nut Oil		22,1
Bayer AG, Dow Corning	Silikonöl VP 1120	Phenyl Trimethicone	22,7
CONDEA Chemie	Isocarb 12	Butyl Octanoicacid	22,1
Henkel Cognis	Isopropylstearat	Isopropyl Stearate	21,9
WITCO, Goldschmidt	Finsolv TN	C12-15 Alkyl Benzoate	21,8

Dr. Straetmans	Dermofeel BGC	Butylene Glycol Caprylate/Caprates	21,5
Unichema Huels	Miglyol 812	Caprylic/Capric Triglyceride	21,3
Trivent (über S. Black)	Trivent OCG	Tricaprylin	20,2
ALZO (ROVI)	Dermol 866	PEG „ Diethylhexanoate/ Diisononanoate/ Ethylhexyl Isononanoate	20,1
Condea Chemie	Isofol 14 T	Butyl Decanol (+) Hexyl Octanol (+) Hexyl Decanol (+) Butyl Octanol	19,8
Lipochemicals INC. / USA (Induchem)	Lipovol MOS-130	Tridecyl Stearate(+) Tridecyl Trimellitate(+) Dipentaerythrityl Hexacaprylate/Hexacaprate	19,4
	Ricinusol		19,2
CONDEA Chemie	Isofol Ester 0604		19,1
Huels CONDEA Chemie	Miglyol 840	Propylene Glycol Dicaprylate/Dicaprate	18,7
CONDEA Chemie	Isofol 12	Butyl Octanol	17,4
Goldschmidt	Tegosoft SH	Stearyl Heptanoate	17,8
	Avocadoöl		14,5
Henkel Cognis	Cetiol B	Dibutyl Adipate	14,3
ALZO (ROVI)	Dermol 488	PEG 2 Diethylenhexanoate	10,1
Condea Augusta S.P.A.	Cosmacol ELI	C12-13 Alkyl Lactate	8,8
ALZO (ROVI)	Dermol 489	Diethylen Glycol Dioctanoate(/ Diisononanoate	8,6
Condea Augusta S.P.A.	Cosmacol ETI	Di-C12/13 Alkyl Tartrate	7,1
Henkel Cognis	Emerest 2384	Propylene Glycol Monoisostearate	6,2
Henkel Cognis	Myritol 331	Cocoglycerides	5,1
Unichema	Prisorine 2041 GTIS	Triisostearin	2,4

Von den Kohlenwasserstoffen sind insbesondere Paraffinöl sowie weitere hydrierte Polyolefine wie hydriertes Polyisobutene, Squalan und Squalen vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden.

Weitere vorteilhafte erfindungsgemäße Lipide mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m sind bei Raumtemperatur flüssige UV-Filtersubstanzen, insbesondere Homomenthylsalicylat (INCI: Homosalate), 2-Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (INCI: Octocrylene), 2-Ethylhexyl-2-hydroxybenzoat (2-Ethylhexylsalicylat, Octylsalicylat, INCI: Octyl Salicylate) und Ester der Zimtsäure, vorzugsweise 4-Methoxyzimtsäure(2-ethylhexyl)-ester (2-Ethylhexyl-4-methoxycinnamat, INCI: Octyl Methoxycinnamate) und 4-Methoxyzimtsäureisopentylester (Isopentyl-4-methoxycinnamat, INCI: Isoamyl p-Methoxycinnamate).

Die erfindungsgemäßen Zubereitungen können dementsprechend ferner vorteilhaft auch in Form von sogenannten ölfreien kosmetischen oder dermatologischen Emulsionen vorliegen, welche eine Wasserphase und mindestens eine bei Raumtemperatur flüssige UV-Filtersubstanz und/oder ein oder mehrere Silikonderivate als weitere Phase enthalten. Ölfreie Formulierungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können vorteilhaft auch weitere lipophile Komponenten – wie beispielsweise lipophile Wirkstoffe – enthalten.

Es ist gegebenenfalls ferner vorteilhaft, wenngleich nicht zwingend, wenn die Lipidphase bis zu 50 Gew.-% – bezogen auf das Gesamtgewicht der Lipidphase – an Lipiden mit einer Polarität  $\geq 30$  mN/m und/oder cyclischen oder linearen Silikonölen und/oder – wachsen enthält.

Vorteilhafte weitere Lipide im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise die im folgenden aufgelisteten:

INCI-Name	Polarität mN/m
Cycloparaffin	49,1
Polydecene	46,7
Hydrogenated Polyisobutene	44,7
Polydimethylsiloxan	46,5
Isohexadecane	43,8
Mineral Oil	43,7
Mineral Oil	43,7

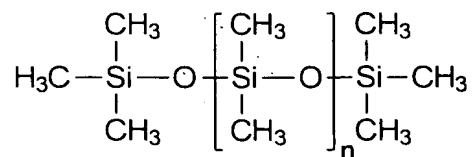
INCI-Name	Polarität
Polydimethylsiloxan	42,4
Isoeikosan	41,9
Polydimethylsiloxan	40,9
Ethoxydiglycol Oleate	40,5
Decyl Olivat	40,3
Dioctylcyclohexane	39,0
Mineral Oil	38,3
Paraffinum Liquidum	37,6
Isocetyl Palmitate	36,2
Cyclopentasiloxan	32,3
Octyl Isostearate	31,6
Dicaprylyl Carbonate	31,7
Trimethylhexyl Isononanoate	31,1
2- Ethylhexyl Isononanoate	31,0
Octyl Cocoate	30,0

Vorteilhaft kann die Ölphase ferner einen Gehalt an cyclischen oder linearen Silikonölen aufweisen oder vollständig aus solchen Ölen bestehen, wobei allerdings bevorzugt wird, außer dem Silikonöl oder den Silikonölen einen zusätzlichen Gehalt an anderen Ölphasenkomponenten zu verwenden.

5

Silikonöle sind hochmolekulare synthetische polymere Verbindungen, in denen Silicium-Atome über Sauerstoff-Atome ketten- und/oder netzartig verknüpft und die restlichen Valenzen des Siliciums durch Kohlenwasserstoff-Reste (meist Methyl-, seltener Ethyl-, Propyl-, Phenyl-Gruppen u. a.) abgesättigt sind. Systematisch werden die Silikonöle als Polyorganosiloxane bezeichnet. Die methylsubstituierten Polyorganosiloxane, welche die mengenmäßig bedeutendsten Verbindungen dieser Gruppe darstellen und sich durch die folgende Strukturformel auszeichnen

10



werden auch als Polydimethylsiloxan bzw. Dimethicon (INCI) bezeichnet. Dimethicone gibt es in verschiedenen Kettenlängen bzw. mit verschiedenen Molekulargewichten.

5 Besonders vorteilhafte Polyorganosiloxane im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise Dimethylpolysiloxane [Poly(dimethylsiloxan)], welche beispielsweise unter den Handelsbezeichnungen Abil 10 bis 10 000 bei Th. Goldschmidt erhältlich sind. Ferner vorteilhaft sind Phenylmethylpolysiloxane (INCI: Phenyl Dimethicone, Phenyl Trimethicone), cyclische Silikone (Octamethylcyclotetrasiloxan bzw. Decamethylcyclopentasiloxan), welche nach INCI auch als Cyclomethicone bezeichnet werden, aminomodifizierte Silikone (INCI: Amodimethicone) und Silikonwachse, z. B. Polysiloxan-Polyalkylen-  
10 Copolymere (INCI: Stearyl Dimethicone und Cetyl Dimethicone) und Dialkoxydimethylpolysiloxane (Stearoxy Dimethicone und Behenoxy Stearyl Dimethicone), welche als verschiedene Abil-Wax-Typen bei Th. Goldschmidt erhältlich sind. Aber auch andere Silikonöle sind vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung zu verwenden, beispielsweise  
15 Cetyldimethicon, Hexamethylcyclotrisiloxan, Polydimethylsiloxan, Poly(methylphenylsiloxan).

Die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Lichtschutzformulierungen können wie üblich zusammengesetzt sein und dem kosmetischen oder dermatologischen  
20 Lichtschutz, ferner zur Behandlung, Pflege und Reinigung der Haut und/oder der Haare und als Schminkprodukt in der dekorativen Kosmetik dienen.

Entsprechend ihrem Aufbau können kosmetische oder topische dermatologische Zusammensetzungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, beispielsweise verwendet werden  
25 als Hautschutzcrème, Reinigungsmilch, Tages- oder Nachtcrème usw. Es ist gegebenenfalls möglich und vorteilhaft, die erfindungsgemäßen Zusammensetzungen als Grundlage für pharmazeutische Formulierungen zu verwenden.

Zur Anwendung werden die kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen in der  
30 für Kosmetika üblichen Weise auf die Haut und/oder die Haare in ausreichender Menge aufgebracht.

Die kosmetischen und dermatologischen Zubereitungen gemäß der Erfindung können kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie sie üblicherweise in solchen Zubereitungen ver-

wendet werden, z. B. Konservierungsmittel, Konservierungshelfer, Bakterizide, Parfüme, Substanzen zum Verhindern des Schäumens, Farbstoffe, Pigmente, die eine färbende Wirkung haben, Verdickungsmittel, anfeuchtende und/oder feuchthaltende Substanzen, Füllstoffe, die das Hautgefühl verbessern, Fette, Öle, Wachse oder andere übliche Bestandteile einer kosmetischen oder dermatologischen Formulierung wie Alkohole, Polyole, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte, organische Lösungsmittel oder Silikon-derivate.

Vorteilhafte Konservierungsmittel im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise Formaldehydabspalter (wie z. B. DMDM Hydantoin, welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Glydant<sup>TM</sup> von der Fa. Lonza erhältlich ist), Iodopropylbutylcarbamate (z. B. die unter den Handelsbezeichnungen Glycakil-L, Glycakil-S von der Fa. Lonza erhältlichen und/oder Dekaben LMB von Jan Dekker), Parabene (d. h. p-Hydroxybenzoesäurealkylester, wie Methyl-, Ethyl-, Propyl- und/oder Butylparaben), Phenoxyethanol, Ethanol, Benzoessäure und dergleichen mehr. Üblicherweise umfaßt das Konservierungssystem erfindungsgemäß ferner vorteilhaft auch Konservierungshelfer, wie beispielsweise Octoxyglycerin, Glycine Soja etc.

Besonders vorteilhafte Zubereitungen werden ferner erhalten, wenn als Zusatz- oder Wirkstoffe Antioxidantien eingesetzt werden. Erfindungsgemäß enthalten die Zubereitungen vorteilhaft eines oder mehrere Antioxidantien. Als günstige, aber dennoch fakultativ zu verwendende Antioxidantien können alle für kosmetische und/oder dermatologische Anwendungen geeigneten oder gebräuchlichen Antioxidantien verwendet werden.

Besonders vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung können wasserlösliche Antioxidantien eingesetzt werden, wie beispielsweise Vitamine, z. B. Ascorbinsäure und deren Derivate sowie D-Biotin, natürliche und/oder synthetische Isoflavonoide, alpha-Glucosylrutin, Panthenol, Aloe Vera.

Die Menge der Antioxidantien (eine oder mehrere Verbindungen) in den Zubereitungen beträgt vorzugsweise 0,001 bis 30 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,05 bis 20 Gew.-%, insbesondere 0,1 bis 10 Gew.-%, bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

Es ist insbesondere vorteilhaft, wenn die kosmetischen Zubereitungen gemäß der vorliegenden Erfindung kosmetische oder dermatologische Wirkstoffe enthalten, wobei bevorzugte Wirkstoffe Antioxidantien sind, welche die Haut vor oxidativer Beanspruchung schützen können.

5

Vorteilhafte weitere Wirkstoffe sind natürliche Wirkstoffe und/oder deren Derivate, wie z. B. Phytoen, Carnitin, Carnosin, Kreatin, Taurin und/oder  $\beta$ -Alanin.

10

Erfindungsgemäße Rezepturen, welche z. B. bekannte Antifaltenwirkstoffe wie Flavonglycoside (insbesondere  $\alpha$ -Glycosylrutin), Coenzym Q10, Vitamin E und/oder Derivate und dergleichen enthalten, eignen sich insbesondere vorteilhaft zur Prophylaxe und Behandlung kosmetischer oder dermatologischer Hautveränderungen, wie sie z. B. bei der Hautalterung auftreten (wie beispielsweise Trockenheit, Rauigkeit und Ausbildung von Trockenheitsfältchen, Juckreiz, verminderte Rückfettung (z. B. nach dem Waschen), sichtbare Gefäßerweiterungen (Teleangiectasien, Cuperosis), Schlaffheit und Ausbildung von Falten und Fältchen, lokale Hyper-, Hypo- und Fehlpigmentierungen (z. B. Altersflecken), vergrößerte Anfälligkeit gegenüber mechanischem Stress (z. B. Rissigkeit) und dergleichen). Weiterhin vorteilhaft eignen sie sich gegen das Erscheinungsbild der trockenen bzw. rauen Haut.

15

20

Die Wasserphase der erfindungsgemäßen Zubereitungen kann vorteilhaft übliche kosmetische Hilfsstoffe enthalten, wie beispielsweise Alkohole, insbesondere solche niedriger C-Zahl, vorzugsweise Ethanol und/oder Isopropanol, Diole oder Polyole niedriger C-Zahl sowie deren Ether, vorzugsweise Propylenglykol, Glycerin, Ethylenglykol, Ethylenglykolmonoethyl- oder -monobutylether, Propylenglykolmonomethyl-, -monoethyl- oder -monobutylether, Diethylenglykolmonomethyl- oder -monoethylether und analoge Produkte, Polymere, Schaumstabilisatoren, Elektrolyte sowie insbesondere ein oder mehrere Verdickungsmittel, welches oder welche vorteilhaft gewählt werden können aus der Gruppe Siliciumdioxid, Aluminiumsilikate, Polysaccharide bzw. deren Derivate, z. B. Hyaluronsäure, Xanthangummi, Hydroxypropylmethylcellulose, besonders vorteilhaft aus der Gruppe der Polyacrylate, bevorzugt ein Polyacrylat aus der Gruppe der sogenannten Carbopole, beispielsweise Carbopole der Typen 980, 981, 1382, 2984, 5984, jeweils einzeln oder in Kombination. Auch Moisturizer können bevorzugt verwendet werden.

25

30

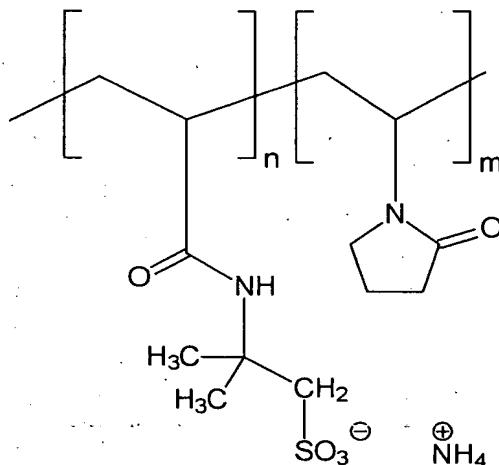


Ferner vorteilhaft sind Copolymere aus C<sub>10-30</sub>-Alkylacrylaten und einem oder mehreren Monomeren der Acrylsäure, der Methacrylsäure oder deren Ester, die kreuzvernetzt sind mit einem Allylether der Saccharose oder einem Allylether des Pentaerythrit.

- 5 Vorteilhaft sind Verbindungen, die die INCI-Bezeichnung „Acrylates/C<sub>10-30</sub> Alkyl Acrylate Crosspolymer“ tragen. Insbesondere vorteilhaft sind die unter den Handelsbezeichnungen Pemulen TR1 und Pemulen TR2 bei der B. F. Goodrich Company erhältlichen.

- 10 Vorteilhaft sind Verbindungen, die die INCI-Bezeichnung Ammoniumacryloyldimethyltaurate/Vinylpyrrolidoncopolymere tragen.

Erfindungsgemäß vorteilhaft weisen das oder die Ammoniumacryloyldimethyltaurate/Vinylpyrrolidoncopolymere die Summenformel  $[C_7H_{16}N_2SO_4]_n [C_6H_9NO]_m$  auf, einer statistischen Struktur wie folgt entsprechend



Bevorzugte Spezies im Sinne der vorliegenden Erfindung sind in den Chemical Abstracts unter den Registraturnummern 58374-69-9, 13162-05-5 und 88-12-0 abgelegt und erhältlich unter der Handelsbezeichnung Aristoflex® AVC der Gesellschaft Clariant GmbH.

Vorteilhaft sind ferner Copolymere/Crosspolymere umfassend Acryloyldimethyl Taurate, wie beispielsweise Simugel® EG oder Simugel® EG von der Gesellschaft Seppic S.A.

Als Moisturizer werden Stoffe oder Stoffgemische bezeichnet, welche kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen die Eigenschaft verleihen, nach dem Auftragen bzw.

Verteilen auf der Hautoberfläche die Feuchtigkeitsabgabe der Hornschicht (auch trans-epidermal water loss (TEWL) genannt) zu reduzieren und/oder die Hydratation der Hornschicht positiv zu beeinflussen.

Vorteilhafte Moisturizer im Sinne der vorliegenden Erfindung sind beispielsweise Glycerin, Milchsäure und/oder Lactate, insbesondere Natriumlactat, Butylenglykol, Propylenglykol, Biosaccharide Gum-1, Glycine Soja, Ethylhexyloxyglycerin, Pyrrolidoncarbonsäure und Harnstoff. Ferner ist es insbesondere von Vorteil, polymere Moisturizer aus der Gruppe der wasserlöslichen und/oder in Wasser quellbaren und/oder mit Hilfe von Wasser gelierbaren Polysaccharide zu verwenden. Insbesondere vorteilhaft sind beispielsweise Hyaluronsäure, Chitosan und/oder ein fucosereiches Polysaccharid, welches in den Chemical Abstracts unter der Registraturnummer 178463-23-5 abgelegt und z. B. unter der Bezeichnung Fucogel®1000 von der Gesellschaft SOLABIA S.A. erhältlich ist.

Die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen können ferner vorteilhaft, wenngleich nicht zwingend, Füllstoffe enthalten, welche z. B. die sensorischen und kosmetischen Eigenschaften der Formulierungen weiter verbessern und beispielsweise ein samtiges oder seidiges Hautgefühl hervorrufen oder verstärken. Vorteilhafte Füllstoffe im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Stärke und Stärkederivate (wie z. B. Tapiocastärke, Distärkephosphat, Aluminium- bzw. Natrium-Stärke Octenylsuccinat und dergleichen), Pigmente, die weder hauptsächlich UV-Filter- noch färbende Wirkung haben (wie z. B. Bornitrid etc.) und/oder Aerosile® (CAS-Nr. 7631-86-9).

Es ist auch vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung, kosmetische und dermatologische Zubereitungen zu erstellen, deren hauptsächlichster Zweck nicht der Schutz vor Sonnenlicht ist, die aber dennoch einen Gehalt an weiteren UV-Schutzsubstanzen enthalten. So werden z. B. in Tagescrèmes oder Makeup-Produkten gewöhnlich UV-A- bzw. UV-B-Filtersubstanzen eingearbeitet. Auch stellen UV-Schutzsubstanzen, ebenso wie Antioxidantien und, gewünschtenfalls, Konservierungsstoffe, einen wirksamen Schutz der Zubereitungen selbst gegen Verderb dar. Günstig sind ferner kosmetische und dermatologische Zubereitungen, die in der Form eines Sonnenschutzmittels vorliegen.

Dementsprechend enthalten die Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung vorzugsweise mindestens eine weitere UV-A-, UV-B- und/oder Breitbandfiltersubstanz. Die Formulierungen können, obgleich nicht notwendig, gegebenenfalls auch ein oder meh-

rere organische und/oder anorganische Pigmente als UV-Filtersubstanzen enthalten, welche in der Wasser- und/oder der Ölphase vorliegen können.

- Bevorzugte anorganische Pigmente sind Metalloxide und/oder andere in Wasser schwer-
- 5 lösliche oder unlösliche Metallverbindungen, insbesondere Oxide des Titans ( $\text{TiO}_2$ ), Zinks ( $\text{ZnO}$ ), Eisens (z. B.  $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ), Zirkoniums ( $\text{ZrO}_2$ ), Siliciums ( $\text{SiO}_2$ ), Mangans (z. B.  $\text{MnO}$ ), Aluminiums ( $\text{Al}_2\text{O}_3$ ), Cers (z. B.  $\text{Ce}_2\text{O}_3$ ), Mischoxide der entsprechenden Metalle sowie Abmischungen aus solchen Oxiden sowie das Sulfat des Bariums ( $\text{BaSO}_4$ ).
- 10 Die Pigmente können vorteilhaft im Sinne der vorliegenden Erfindung auch in Form kommerziell erhältlicher ölig oder wäßriger Vordispersionen zur Anwendung kommen. Diesen Vordispersionen können vorteilhaft Dispergierhilfsmittel und/oder Solubilisations-
- 15 vermittler zugesetzt sein.
- Die Pigmente können erfindungsgemäß vorteilhaft oberflächlich behandelt („gecoatet“) sein, wobei beispielsweise ein hydrophiler, amphiphiler oder hydrophober Charakter gebildet werden bzw. erhalten bleiben soll. Diese Oberflächenbehandlung kann darin bestehen, daß die Pigmente nach an sich bekannten Verfahren mit einer dünnen hydrophilen und/oder hydrophoben anorganischen und/oder organischen Schicht versehen werden.
- 20 Die verschiedenen Oberflächenbeschichtungen können im Sinne der vorliegenden Erfindung auch Wasser enthalten.

Anorganische Oberflächenbeschichtungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können bestehen aus Aluminiumoxid ( $\text{Al}_2\text{O}_3$ ), Aluminiumhydroxid  $\text{Al}(\text{OH})_3$ , bzw. Aluminiumoxid-

25 hydrat (auch: Alumina, CAS-Nr.: 1333-84-2), Natriumhexametaphosphat ( $\text{NaPO}_3$ )<sub>6</sub>, Natriummetaphosphat ( $\text{NaPO}_3$ )<sub>n</sub>, Siliciumdioxid ( $\text{SiO}_2$ ) (auch: Silica, CAS-Nr.: 7631-86-9), oder Eisenoxid ( $\text{Fe}_2\text{O}_3$ ). Diese anorganischen Oberflächenbeschichtungen können allein, in Kombination und/oder in Kombination mit organischen Beschichtungsmaterialien vor-

kommen.

30

Organische Oberflächenbeschichtungen im Sinne der vorliegenden Erfindung können bestehen aus pflanzlichem oder tierischem Aluminiumstearat, pflanzlicher oder tierischer Stearinsäure, Laurinsäure, Dimethylpolysiloxan (auch: Dimethicone), Methylpolysiloxan (Methicone), Simethicone (einem Gemisch aus Dimethylpolysiloxan mit einer durch-

schnittlichen Kettenlänge von 200 bis 350 Dimethylsiloxan-Einheiten und Silicagel) oder Alginsäure. Diese organischen Oberflächenbeschichtungen können allein, in Kombination und/oder in Kombination mit anorganischen Beschichtungsmaterialien vorkommen.

- 5 Erfindungsgemäß geeignete Zinkoxidpartikel und Vordispersionen von Zinkoxidpartikeln sind unter folgenden Handelsbezeichnungen bei den aufgeführten Firmen erhältlich:

Handelsname	Coating	Hersteller
Z- Cote HP1	2% Dimethicone	BASF
Z- Cote	/	BASF
ZnO NDM	5% Dimethicone	H&R
ZnO Neutral	/	H & R
MZ 505 M	5% Methicone	Tayca Corp.

- 10 Geeignete Titandioxidpartikel und Vordispersionen von Titandioxidpartikeln sind unter folgenden Handelsbezeichnungen bei den aufgeführten Firmen erhältlich:

Handelsname	Coating	Hersteller
MT-100TV	Aluminiumhydroxid / Stearinsäure	Tayca Corporation
MT-100Z	Aluminiumhydroxid / Stearinsäure	Tayca Corporation
Eusolex T-2000	Alumina / Simethicone	Merck KgaA
Titandioxid T805 (Uvinul TiO <sub>2</sub> )	Octyltrimethylsilan	Degussa
Tioveil AQ 10PG	Alumina / Silica	Solaveil / Uniquema

- 15 Weitere vorteilhafte Pigmente sind Latexpartikel. Erfindungsgemäß vorteilhafte Latexpartikel sind die in den folgenden Schriften beschriebenen: US 5,663,213 bzw. EP 0 761 201. Besonders vorteilhafte Latexpartikel sind solche, welche aus Wasser und Styrol/Acrylat-Copolymeren gebildet werden und z. B. unter der Handelsbezeichnung „Alliance SunSphere“ bei der Fa. Rohm & Haas erhältlich sind.

- 20 Vorteilhafte UV-A-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind Dibenzoylmethanderivate, insbesondere das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan (CAS-Nr.

70356-09-1), welches von Givaudan unter der Marke Parsol® 1789 und von Merck unter der Handelsbezeichnung Eusolex® 9020 verkauft wird.

Vorteilhafte weitere UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind sulfonierte, wasserlösliche UV-Filter, wie z. B.

- Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure und ihre Salze, besonders die entsprechenden Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salze, insbesondere das Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz mit der INCI-Bezeichnung Bisimidazylate (CAS-Nr.: 180898-37-7), welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Neo Heliopan AP bei Haarmann & Reimer erhältlich ist;
- Salze der 2-Phenylbenzimidazol-5-sulfonsäure, wie ihr Natrium-, Kalium- oder ihr Triethanolammonium-Salz sowie die Sulfonsäure selbst mit der INCI Bezeichnung Phenylbenzimidazole Sulfonsäure (CAS.-Nr. 27503-81-7), welches beispielsweise unter der Handelsbezeichnung Eusolex 232 bei Merck oder unter Neo Heliopan Hydro bei Haarmann & Reimer erhältlich ist;
- 1,4-di(2-oxo-10-Sulfo-3-bornylidenmethyl)-Benzol (auch: 3,3'-(1,4-Phenylendimethylene)-bis-(7,7-dimethyl-2-oxo-bicyclo-[2.2.1]hept-1-ylmethan Sulfonsäure) und dessen Salze (besonders die entsprechenden 10-Sulfato-verbindungen, insbesondere das entsprechende Natrium-, Kalium- oder Triethanolammonium-Salz), das auch als Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) bezeichnet wird. Benzol-1,4-di(2-oxo-3-bornylidenmethyl-10-sulfonsäure) hat die INCI-Bezeichnung Terephtalidene Dicampher Sulfonsäure (CAS.-Nr.: 90457-82-2) und ist beispielsweise unter dem Handelsnamen Mexoryl SX von der Fa. Chimex erhältlich;
- Sulfonsäure-Derivate des 3-Benzylidencamphers, wie z. B. 4-(2-Oxo-3-bornylidenmethyl)benzolsulfonsäure, 2-Methyl-5-(2-oxo-3-bornylidenmethyl)sulfonsäure und deren Salze.

Vorteilhafte UV-Filtersubstanzen im Sinne der vorliegenden Erfindung sind ferner sogenannte Breitbandfilter, d.h. Filtersubstanzen, die sowohl UV-A- als auch UV-B-Strahlung absorbieren.

Vorteilhafte Breitbandfilter oder UV-B-Filtersubstanzen sind beispielsweise Triazinderivate, wie z. B.

- 2,4-Bis-[[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin (INCI: Methylene Bis-Benzotriazolmethylbutylphenol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® S bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist;
- Dioctylbutylamidotriazon (INCI: Diethylhexylbutamidotriazone), welches unter der Handelsbezeichnung UVASORB HEB bei Sigma 3V erhältlich ist;
- 4,4',4''-(1,3,5-Triazin-2,4,6-triyltrimino)-tris-benzoësäure-tris(2-ethylhexylester), auch: 2,4,6-Tris-[anilino-(p-carbo-2'-ethyl-1'-hexyloxy)]-1,3,5-triazin (INCI: Octyl Triazone), welches von der BASF Aktiengesellschaft unter der Warenbezeichnung UVINUL® T 150 vertrieben wird.

Ein vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist auch das 2,2'-Methylen-bis-(6-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-(1,1,3,3-tetramethylbutyl)-phenol) (INCI: Bisoctyl-triazol), welches unter der Handelsbezeichnung Tinosorb® M bei der CIBA-Chemikalien GmbH erhältlich ist.

Vorteilhafter Breitbandfilter im Sinne der vorliegenden Erfindung ist ferner das 2-(2H-benzotriazol-2-yl)-4-methyl-6-[2-methyl-3-[1,3,3,3-tetramethyl-1-[(trimethylsilyl)oxy]disiloxanyl]propyl]-phenol (CAS-Nr.: 155633-54-8) mit der INCI-Bezeichnung Drometrizole Trisiloxane.

Die weiteren UV-Filtersubstanzen können öllöslich sein. Vorteilhafte öllösliche Filtersubstanzen sind z. B.:

- 3-Benzylidencampher-Derivate, vorzugsweise 3-(4-Methylbenzyliden)campher, 3-Benzylidencampher;
- 4-Aminobenzoësäure-Derivate, vorzugsweise 4-(Dimethylamino)-benzoësäure(2-ethylhexyl)ester, 4-(Dimethylamino)benzoësäureamylester;
- Derivate des Benzophenons, vorzugsweise 2-Hydroxy-4-methoxybenzophenon, 2-Hydroxy-4-methoxy-4'-methylbenzophenon, 2,2'-Dihydroxy-4-methoxybenzophenon sowie an Polymere gebundene UV-Filter.

Eine weitere erfindungsgemäß vorteilhaft zu verwendende Lichtschutzfiltersubstanz ist das Ethylhexyl-2-cyano-3,3-diphenylacrylat (Octocrylen), welches von BASF unter der Bezeichnung Uvinul® N 539 erhältlich ist.

- 5 Besonders vorteilhafte Zubereitungen im Sinne der vorliegenden Erfindung, die sich durch einen hohen bzw. sehr hohen UV-A-Schutz auszeichnen, enthalten neben der oder den erfindungsgemäßen Filtersubstanz(en) bevorzugt ferner weitere UV-A- und/oder Breitbandfilter, insbesondere Dibenzoylmethanderivate [beispielsweise das 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan] und/oder das 2,4-Bis-[[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen
- 10 miteinander.

Die Liste der genannten UV-Filter, die im Sinne der vorliegenden Erfindung eingesetzt werden können, soll selbstverständlich nicht limitierend sein.

15

Vorteilhaft enthalten die erfindungsgemäßen Zubereitungen die Substanzen, die UV-Strahlung im UV-A- und/oder UV-B-Bereich absorbieren, in einer Gesamtmenge von z. B. 0,1 Gew.-% bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,5 bis 20 Gew.-%, insbesondere 1,0 bis 15,0 Gew.-%, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitungen, um kosmetische Zubereitungen zur Verfügung zu stellen, die das Haar bzw. die Haut vor dem gesamten Bereich der ultravioletten Strahlung schützen.

20

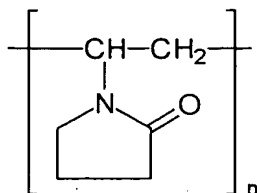
25

Ferner kann es gegebenenfalls von Vorteil sein, Filmbildner in die erfindungsgemäßen kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen einzuarbeiten, beispielsweise um die Wasserfestigkeit der Zubereitungen zu verbessern oder die UV-Schutzleistung zu erhöhen (UV-A- und/oder UV-B-Boosting). Geeignet sind sowohl wasserlösliche bzw. dispergierbare als auch fettlösliche Filmbildner, jeweils einzeln oder in Kombination miteinander.

30

Vorteilhafte wasserlöslich bzw. dispergierbare Filmbildner sind z. B. Polyurethane (z. B. die Avalure® -Typen von Goodrich), Dimethicone Copolyol Polyacrylate (Silsoft Surface® von der Witco Organo Silicones Group), PVP/VA (VA = Vinylacetat) Copolymer (Luviscol VA 64 Powder der BASF) etc.

Vorteilhafte fettlösliche Filmbildner sind z. B., die Filmbildner aus der Gruppe der Polymere auf Basis von Polyvinylpyrrolidon (PVP)



Besonders bevorzugt sind Copolymere des Polyvinylpyrrolidons, beispielsweise das PVP Hexadecen Copolymer und das PVP Eicosen Copolymer, welche unter den Handelsbezeichnungen Antaron V216 und Antaron V220 bei der GAF Chemicals Cooperation erhältlich sind, sowie das Tricontayl PVP und dergleichen mehr.

Die nachfolgenden Beispiele sollen die vorliegende Erfindung verdeutlichen, ohne sie einzuschränken. Die Zahlenwerte in den Beispielen bedeuten Gewichtsprozente, bezogen auf das Gesamtgewicht der jeweiligen Zubereitungen.



**Beispiele:****1. O/W Sonnenschutz Emulsionen**

	1	2	3	4	5	6	7
Glycerinmonostearat SE	0,50	1,00	3,00			1,50	
Glyceryl Stearat Citrat	2,00			1,00	1,00		2,50
Stearinsäure		3,00		2,00			
PEG-40 Stearat	0,50					2,00	
PEG-100 Stearat		1,50			3,00		
Cetyl Phosphat					1,00		
Stearyl Alkohol			3,00			2,00	0,50
Cetyl Alkohol	2,50	1,00		1,50	0,50		2,00
Ethylhexyl Methoxycinnamat				5,00	6,00		8,00
Aniso Triazin		1,50		2,00	2,50		2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethan	3,00	3,00	2,00				1,50
Bisimidazylat			0,50		1,00		0,30
Ethylhexyl Triazon	4,00		3,00		4,00		
4-Methylbenzyliden Campher							2,00
Octocrylen	10,0	4,00					2,50
Diethylhexyl Butamido Triazon	1,00			2,00	1,00		
Phenylbenzimidazol Sulfon- säure	0,50			3,00			
Bisoctyltriazol	2,00		0,50	1,50	2,50		
Benzophenon-3				5,50			
Homosalat		2,00					
Ethylhexylsalicylat			3,00				5,00
Drometrisol Trisiloxan			0,5				
Terephthaliden Dicamphor Sulfonsäure		1,50			1,00		
Diethylhexyl-2,6-naphthalat	10,0	4,80	7,00	9,50	6,70	5,50	8,00
Titandioxid MT-100Z	1,00			3,00			
Z-Cote HP1			1,50	1,00			3,00
C12-15 Alkyl Benzoat		2,50			4,00	7,00	5,00

Dicaprylyl Ether			3,50		2,00		
Butylenglycol Dicaprylat/Dicaprat	5,00			6,00			
Dicaprylyl Carbonat			6,00			2,00	2,00
Dimethicon		0,50	1,00		2,00		
Dibutyl Adipat				3,00			
Coco-Caprylat/Caprat		4,50			5,00		
Cyclomethicon	2,00			0,50	3,00		0,50
Shea Butter		2,00					0,50
PVP Hexadecen Copolymer	0,50			0,50	1,00		1,00
Tricontanyl PVP		0,50	1,00				1,00
Glycerin	3,00	7,50		7,50	5,00		2,50
Xanthan Gummi	0,15		0,05				0,30
Sodium Carbomer		0,20	0,10	0,20			
Vitamin E	0,50		0,25		0,75		1,00
Vitamin A		0,15					
Fucogel® 1000			1,50	3,00			
Polyurethan				0,50			
Styrene/Acrylat Copolymer	0,80						
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20			
Konkaben LMB ®				0,18	0,20		0,15
EDTA	0,20		0,75		0,35	0,15	
Methylparaben	0,15		0,25		0,50		
Phenoxyethanol	1,00	0,40		0,40	0,50	0,40	0,60
Ethanol		2,00	1,50		3,00		1,00
Parfüm	0,20		0,20		0,20	0,20	0,20
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

## 2. Hydrodispersionen

	1	2	3	4	5
Cetareth-20	1,00				

Cetyl Alkohol			1,00		
Sodium Carbomer		0,20		0,30	
Acrylates/C10-30 Alkyl Acrylat Crosspolymer	0,50		0,40	0,10	0,10
Xanthan Gummi		0,30	0,15		0,50
Aristoflex® AVC	0,50				
Ethylhexyl Methoxycinnamat				5,00	8,00
Aniso Triazin		1,50		2,00	2,50
Butyl Methoxydibenzoylmethan	1,00	0,50		3,00	
Bisimidazylat		1,80		2,00	3,00
Ethylhexyl Triazon	4,00		3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Camphor	4,00				
Octocrylen		4,00	3,90		2,50
Diethylhexyl Butamido Triazon	1,00			2,00	
Phenylbenzimidazol Sulfonsäure	0,50			3,00	
Bisoctyltriazol	2,50	0,50			0,80
Drometrisol Trisiloxan			1,00		1,50
Terephthaliden Dicamphor Sul- fonsäure		0,50			1,00
Diethylhexyl-2,6-naphthalat	4,50	8,00	7,20	5,50	15,00
Titandioxid MT-100TV	0,50		2,00		1,00
Zinkoxid NDM			1,00		
C12-15 Alkyl Benzoat	2,00	2,50			
Octyldodekanol		4,00	5,00		
Butylenglycol Dicaprylat/Dicaprat	4,00		2,00	6,00	
Dicaprylyl Carbonat		2,00	6,00		
Isohexadecen	3,00				
Dimethicon		0,50	1,00		
Phenyltrimethicon	2,00			0,50	2,00
Shea Butter		2,00			
PVP Hexadecen Copolymer	0,50			0,50	1,00
Tricontanyl PVP	0,50		1,00		
Ethylhexylglycerin			1,00		0,50

Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycin Soja			1,50		
Vitamin E	0,50		0,25		1,00
Vitamin F		0,50			
$\alpha$ -Glycosilrutin			0,20		
Polyurethan		0,60	1,50	1,00	
Styrene/Acrylat Copolymer		2,50	0,50		
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Konkaben LMB ®	0,20				
Octoxyglycerin		0,25			1,00
EDTA	0,15	0,05	0,50		
Glycin Soja			0,50		1,50
Methylparaben	0,50		0,25	0,15	
Phenoxyethanol	0,50	0,40		1,00	
Ethanol	3,00	2,00	1,50		7,00
Parfüm	0,20	0,20	0,20		
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

### 3. W/O Sonnenschutz Emulsionen

	1	2	3	4	5
Cetyldimethicon Copolyol		2,50		4,00	
Polyglyceryl-2-dipolyhydroxystearat	5,00	2,50			4,50
PEG-30-dipolyhydroxystearat			5,00		
Laurylmethicon Copolyol			2,00		
Ethylhexyl Methoxycinnamat		8,00		5,00	
Aniso Triazin		2,50		2,00	
Butyl Methoxydibenzoylmethan		3,00	2,00	1,00	
Bisimidazylat				2,00	2,60
Ethylhexyl Triazon			3,00	4,00	
4-Methylbenzyliden Camphor		2,00		4,00	2,00
Octocrylen		2,50	3,90		10,0
Diethylhexyl Butamido Triazon				2,00	

Phenylbenzimidazol Sulfonsäure			0,50	3,00	
Bisoctyltriazol			2,00	0,50	
Drometrisol Trisiloxan		1,00			1,50
Terephthaliden Dicamphor Sulfonsäure			1,00		0,50
Diethylhexyl-2,6-naphthalat	7,50	5,50	3,50	8,80	9,70
Titandioxid T805		2,00	1,50		3,00
Z-Cote HP1					7,00
Mineralöl			10,0		8,00
C12-15 Alkyl Benzoat				9,00	
Dicaprylyl Ether	10,00				7,00
Butylenglycol Dicaprylat/Dicaprat			2,00	8,00	4,00
Dicaprylyl Carbonat	5,00		6,00		
Cocoglyceride		3,00			5,50
Dibutyl Adipat				4,50	
Dimethicon		4,00	1,00	5,00	
Cyclomethicon	2,00	25,00			2,00
Shea Butter			3,00		
PVP Hexadecen Copolymer	0,50			0,50	1,00
Tricontanyl PVP			0,50	1,00	0,50
Ethylhexylglycerin		0,30	1,00		0,50
Glycerin	3,00	7,50		7,50	2,50
Glycine Soja		1,00	1,50		
MgSO <sub>4</sub>	1,00	0,50		0,50	
MgCl <sub>2</sub>			1,00		0,70
Vitamin E Acetat	0,50		0,25		1,00
Ubichinon Q 10	0,25	0,10			
Panthenol			0,50		
Iminodibemsteinsäure	0,30			0,50	
DMDM Hydantoin		0,60	0,40	0,20	
Methylparaben	0,50		0,25	0,15	
Phenoxyethanol	0,50	0,40		1,00	0,60
Ethanol	3,00		1,50		1,00

Parfüm	0,20		0,20		0,20
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

#### 4. Feststoffstabilisierte Emulsionen

	1	2	3	4	5
Mineralöl			16,0	16,0	
Octyldodecanol	9,0	9,0	5,0		
Caprylic/Capric Triglycerid	9,0	9,0	6,0		
C12-15- Alkyl Benzoat				5,0	8,0
Butylen Glycol Dicaprylat/Dicaprat					8,0
Dicaprylyl Ether	9,0			4,0	
Dicaprylyl Carbonat		9,0			
Hydroxyoctacosanyl Hydroxystearat	2,0	2,0	2,0	2,0	1,5
Disteardimonium Hectorit	1,0	0,75	0,5	0,5	0,25
Cera Microcristallina + Paraffinum Liquidum					5,0
Hydroxypropyl Methylcellulose					0,05
Dimethicon					3,0
Butyl methoxydibenzoylmethan		0,50	3,50		0,50
Ethylhexylmethoxycinnamat	10,00				3,0
4-Methylbenzyliden Camphor					4,0
Diethylhexyl Butamido Triazon					4,0
Aniso Triazin	0,50			2,0	
Drometrisol Trisiloxan		0,50		1,00	
Terephthaliden Dicamphor Sulfonsäure		1,00	0,50		1,50
Bisimidazylat	2,50			1,50	0,50
Eusolex® T-2000		2,0	4,0	2,0	4,0
Uvinul ® T805					3,0
Zinkoxid HP1	1,50			6,0	
Silica Dimethyl Silylat			1,0		0,50
Bornitrid	2,0				

Stärke/-Natriummetaphosphat-Polymer		0,5			
Diethylhexyl-2,6-naphthalat	5,00	7,00	8,50	3,00	4,50
Tapioca Stärke				1,0	
Natrium Chlorid	1,0	1,0	1,0	1,0	1,0
Glycerin	5,0	10,0	3,0	6,0	10,0
Trinatrium EDTA		1,0		1,0	
Methylparaben	0,21				0,2
Propylparaben	0,07				
Phenoxyethanol	0,5		0,4	0,4	0,5
Hexamidin Diisethionat					0,08
Diazolidinyl Harnstoff			0,28	0,28	
Alcohol				2,5	
Parfüm	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.	q.s.
Wasser	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100	ad 100

### 5. PIT - Emulsionen

	1	2	3	4	5	6	7	8
Glycerinmonostearat SE	0,50	2,00	3,00	5,00			0,50	4,00
Glyceryl Isostearat					3,50	4,00	2,00	
Isoceteth-20		0,50			2,00			
Cetareth-12		5,00		1,00				3,50
Cetareth-20				2,00		2,50	3,00	
PEG-100 Stearat	5,00		1,00		1,00			0,50
Cetyl Alkohol	2,50	1,00		1,50		0,50	1,50	
Cetyl Palmitat				0,50		1,00		
Cetyl Dimethicon Copolyol	0,50				0,50		1,00	
Polyglyceryl-2 Dipolyhydroxystearat				0,75	0,25			
Diethylhexyl-2,6-naphthalat	7,0	3,5	1,0	6,0	0,5	4,0	5,0	4,5
Aniso Triazin			0,50	2,00		3,00		
Butyl Methoxydibenzoylmethan	1,50		1,00					

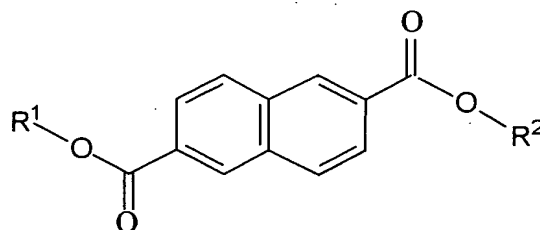




Patentansprüche:

1. Kosmetische und dermatologische Formulierungen mit mindestens einem oxidations- und/oder UV-empfindlichen Wirkstoff, dadurch gekennzeichnet, daß sie

(a) mindestens ein Dialkylnaphthalat, welches sich durch die Strukturformel



auszeichnet,

worin R¹ und R² unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen,

und

(b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m enthalten.

2. Zubereitung nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß der Gehalt an einem oder mehreren Dialkylnaphthalaten aus dem Bereich von 0,001 bis 30 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 20 Gew.-%, besonders bevorzugt 0,5 bis 15 Gew.-% gewählt wird, jeweils bezogen auf das Gesamtgewicht der Zubereitung.

3. Zubereitung nach einem der Ansprüche 1 oder 2, dadurch gekennzeichnet, daß der oxidations- und/oder UV-empfindliche Wirkstoff 4-(tert.-Butyl)-4'-methoxydibenzoylmethan ist.

4. Zubereitung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß oxidations- und/oder UV-empfindliche Wirkstoff aus der Gruppe der lipophilen Wirkstoffe gewählt wird.

5. Zubereitung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß oxidations- und/oder UV-empfindliche Wirkstoff aus der folgenden Gruppe gewählt wird:

- Coenzym Q10,

- Vitamin A und Derivate,
- Vitamin E und Derivate,
- Liponsäure und Derivate,
- Carotinoide.

5

6. Zubereitung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß sie mindestens eine UV-Filtersubstanz, gewählt aus der Gruppe Triazine, Benzotriazole und organische und/oder anorganische Pigmente, enthält.

10

7. Zubereitung nach einem der vorhergehenden Ansprüche, dadurch gekennzeichnet, daß sie mindestens eine UV-A-Filtersubstanz und/oder einen Breitbandfilter, gewählt aus der Gruppe 2,4-Bis-[[4-(2-Ethyl-hexyloxy)-2-hydroxy]-phenyl]-6-(4-methoxyphenyl)-1,3,5-triazin, Phenylen-1,4-bis-(2-benzimidazolyl)-3,3'-5,5'-tetrasulfonsäure-bis-natriumsalz, enthält, wobei die weiteren Filtersubstanzen jeweils einzeln oder in beliebigen Kombinationen miteinander vorliegen können.

15

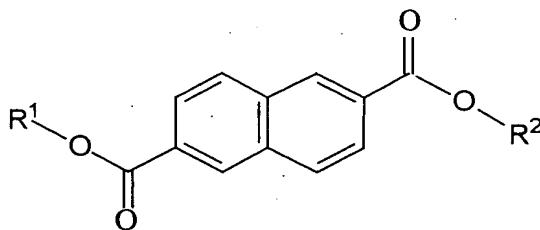
8. Verwendung von Zubereitungen nach einem der vorhergehenden Ansprüche zur Hautbefeuchtung.

20

9. Verwendung von Zubereitungen nach einem der Ansprüche 1 bis 6 zum Schutz vor lichtbedingter Hautalterung.

10. Verwendung von Stoffkombinationen, welche

(a) mindestens ein Dialkyl-naphthalat, welches sich durch die Strukturformel



25

auszeichnet,

worin  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen, und

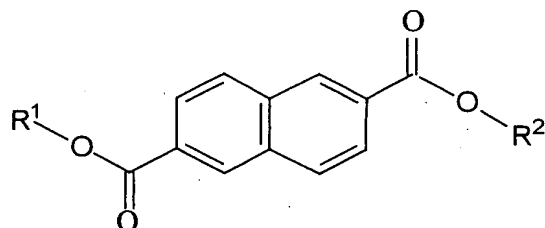
30

(b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m

enthalten,  
zur Stabilisierung kosmetischer oder dermatologischer Wirkstoffe gegen die durch UV-Strahlung induzierte Zersetzung.

5 11. Verwendung von Stoffkombinationen, welche

(a) mindestens ein Dialkylnaphthalat, welches sich durch die Strukturformel



auszeichnet,

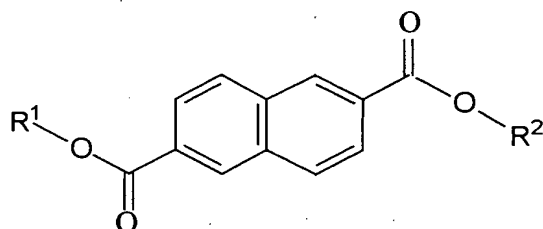
worin  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen, und

(b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m enthalten, zur Verbesserung der Wirksamkeit und zur Erhöhung der Stabilität von lipophilen Wirkstoffen in kosmetischen oder dermatologischen Zubereitungen.

Zusammenfassung:

Kosmetische und dermatologische Formulierungen mit mindestens einem oxidations- und/oder UV-empfindlichen Wirkstoff, dadurch gekennzeichnet, daß sie

- 5 (a) mindestens ein Dialkyl-naphthalat, welches sich durch die Strukturformel



auszeichnet,

worin  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander gewählt werden aus der Gruppe der verzweigten und unverzweigten Alkylgruppen mit 6 bis 24 Kohlenstoffatomen,

und

- 10 (b) mindestens ein Lipid mit einer Polarität von höchstens 30 mN/m  
enthalten  
und ihre Verwendung.